



**PCT**  
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :  C07D 275/02, A01N 43/80		A2	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 99/24413</b>		
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/07056		(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Mai 1999 (20.05.99)			
(22) Internationales Anmeldedatum: 5. November 1998 (05.11.98)					
(30) Prioritätsdaten: 197 50 012.9 12. November 1997 (12.11.97) DE		(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).			
(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).		(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).			
(72) Erfinder; und		Veröffentlicht			
(75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): ASSMANN, Lutz [DE/DE]; Schimmelreiterweg 6, D-25826 St. Peter-Ording (DE). KUHNT, Dietmar [DE/DE]; Eschenallee 6d, D-51399 Burscheid (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, D-42329 Wuppertal (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüschhof 15, D-42799 Leichlingen (DE). DUTZMANN, Stefan [DE/DE]; Weissenstein 95, D-40764 Langenfeld (DE). HANSSLER, Gerd [DE/DE]; Am Arenzberg 58a, D-51381 Leverkusen (DE). STENZEL, Klaus [DE/DE]; Seesener Strasse 17, D-40595 Düsseldorf (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 46a, D-42799 Leichlingen (DE). KITAGAWA, Yoshinori [JP/JP]; 1085, Ara-machi, Moka-shi, Tochigi 321-4305 (JP). SAWADA, Haruko [JP/JP]; 848-4, Oba-		<i>Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.</i>			
(54) Title: ISOTHIAZOLE CARBOXYLIC ACID AMIDES AND THE APPLICATION THEREOF IN ORDER TO PROTECT PLANTS					
(54) Bezeichnung: ISOTHIAZOLCARBONSÄUREAMIDE UND DEREN VERWENDUNG ZUM SCHUTZ VON PFLANZEN					
<span style="margin-left: 200px;">(I)</span>					
(57) Abstract					
<p>The invention relates to novel isothiazole carboxylic acid amides of formula (I) in which R has the meanings given in the description. The invention also relates to additional methods for producing the novel materials and the application thereof in order to protect plants against attack by undesired microorganisms and animal pests.</p>					
(57) Zusammenfassung					
<p>Neue Isothiazolcarbonsäureamide der Formel (I) in welcher R die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen hat, mehrere Verfahren zur Herstellung der neuen Stoffe und deren Verwendung zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge.</p>					

#### ***LEDIGLICH ZUR INFORMATION***

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		

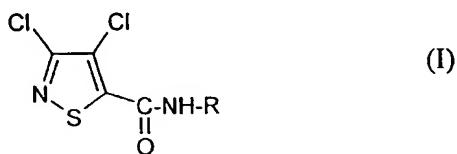
- I -

## ISOTHIAZOLCARBONSÄUREAMIDE UND DEREN VERWENDUNG ZUM SCHUTZ VON PFLANZEN

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Isothiazolcarbonsäureamide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge.

Es ist bereits bekannt geworden, daß zahlreiche Isothiazolcarbonsäure-Derivate fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. US-A 5 240 951 und JP-A 06-009 313). So lassen sich z.B. 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-ethylamid und 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-(4-chlor-anilid) zur Bekämpfung von Pilzen einsetzen. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, läßt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

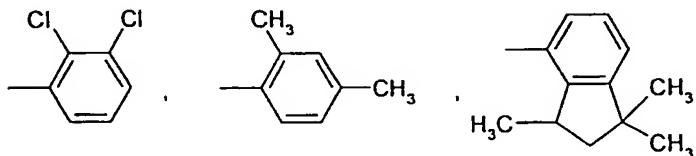
15 Es wurden nun neue Isothiazolcarbonsäureamide der Formel



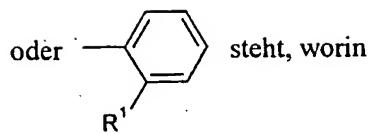
in welcher

20

R für einen Rest der Formel



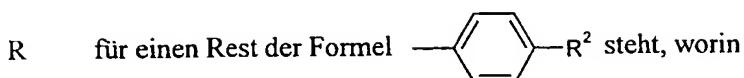
- 2 -



$R^1$  für Cyano, Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

5

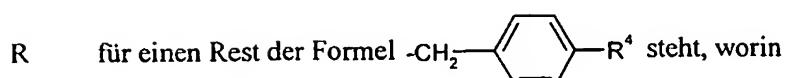
oder



10  $R^2$  für  $-C(CH_3)_3$ ,  $\begin{array}{c} \text{---CH---C}_2\text{H}_5 \\ | \\ C_2\text{H}_5 \end{array}$ ,  $\begin{array}{c} \text{---CH---C}_2\text{H}_5 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$ , Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für  $-\text{CH}_2\text{-S-}R^3$  steht, wobei

15  $R^3$  für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen substituiertes Phenyl steht,

oder



20

$R^4$  für Wasserstoff oder N,N-Dialkylaminomethyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil steht,

oder

25

- 3 -

R für einen Rest der Formel  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-}\begin{array}{c} \text{R}^5 \\ | \\ \text{C}_6\text{H}_4 \\ | \\ \text{R}^6 \end{array}$  steht, worin

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

5 R<sup>6</sup> für Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenyl oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenoxy steht,

oder

10 R<sup>5</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenoxy steht und

R<sup>6</sup> für Wasserstoff steht,

15 oder

R für einen Rest der Formel  $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2\text{-}\begin{array}{c} \text{COOR}^7 \\ | \\ \text{CH} \end{array}$ ,  $-\text{CH}_2\text{-N}(\text{CHO})\text{-R}^8$  oder  
 $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-R}^9$  steht, worin

20 R<sup>7</sup> für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

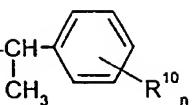
R<sup>8</sup> für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

R<sup>9</sup> für Wasserstoff oder einen Rest der Formel

25  $-\text{SO-O-CH}_2\text{-CH}_2\text{-NH-C(=O)-}\begin{array}{c} \text{Cl} \\ | \\ \text{S} \\ || \\ \text{Cl} \end{array}$  oder  $-\text{C(=O)-}\begin{array}{c} \text{Cl} \\ | \\ \text{S} \\ || \\ \text{Cl} \end{array}$  steht,

- 4 -

oder

R für einen Rest der Formel  steht, worin

5

$R^{10}$  für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

n für ganze Zahlen von 0 bis 3 steht,

10

gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, daß sich Isothiazolcarbonsäureamide der Formel (I) herstellen lassen, indem man

15

a) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid der Formel



20

mit Aminen der Formel



in welcher

25

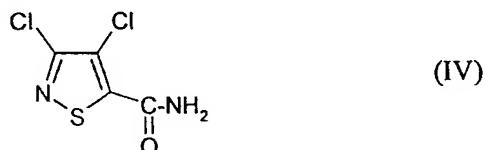
R die oben angegebenen Bedeutungen hat,

- 5 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

5 oder

b) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid der Formel

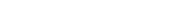


10

## mit Hydroxyverbindungen der Formel

$$\text{HO}-\text{CH}_2-\text{X} \quad (\text{V})$$

15 in welcher

X für einen Rest der Formel  ,   
 oder  steht, worin

20  $R^4, R^5, R^6$  und  $R^8$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabspaltenden Mittels umsetzt.

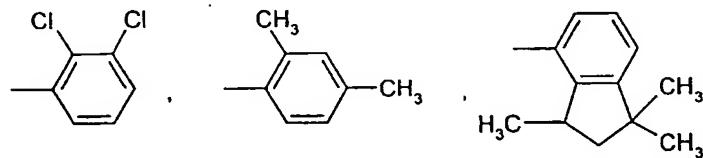
- 6 -

Schließlich wurde gefunden, daß die Isothiazolcarbonsäureamide der Formel (I) sehr gut zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen verwendbar sind. Die erfindungsgemäßen Stoffe eignen sich sowohl zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte 5 Mikroorganismen als auch als Mikrobizide zur direkten Bekämpfung der Mikroorganismen. Außerdem zeigen die erfindungsgemäßen Stoffe auch eine Wirkung gegen tierische Pflanzenschädlinge.

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Stoffe eine bessere 10 mikrobizide Wirksamkeit als 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-ethylamid und 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-(4-chlor-anilid), welches konstitutionell ähnliche, vorbekannte Wirkstoffe gleicher Wirkungsrichtung sind.

Die erfindungsgemäßen Isothiazolcarbonsäureamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen 15

R für einen Rest der Formel

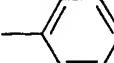


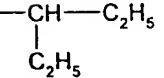
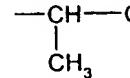
20 oder steht, worin

R<sup>1</sup> für Cyano, Phenyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Cycloheptyl steht,

oder

- 7 -

R für einen Rest der Formel  -R<sup>2</sup> steht, worin

R<sup>2</sup> für -C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>,  ,  , Cyclopentyl,

Cyclohexyl, Cycloheptyl oder für -CH<sub>2</sub>-S-R<sup>3</sup> steht, wobei

5

R<sup>3</sup> für Alkyl mit 1 bis 5 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Phenyl steht,

10

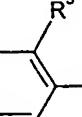
oder

R für einen Rest der Formel -CH<sub>2</sub> -R<sup>4</sup> steht, worin

15

R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder N,N-Dialkyl-aminomethyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil steht,

oder

20 R für einen Rest der Formel -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub> -R<sup>6</sup> steht, worin

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder Alkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen steht und

- 8 -

R<sup>6</sup> für Alkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenoxy steht,  
5

oder

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenoxy steht und  
10

R<sup>6</sup> für Wasserstoff steht,

oder

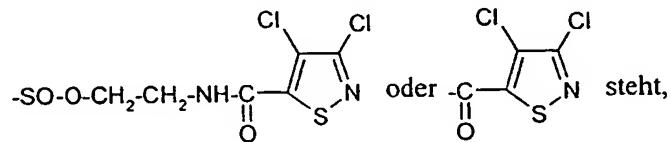
15

R für einen Rest der Formel  $\begin{array}{c} \text{COOR}^7 \\ | \\ -\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$ ,  $-\text{CH}_2-\text{N}^{\text{R}}\text{CHO}$  oder  
-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-R<sup>9</sup> steht, worin

R<sup>7</sup> für Methyl oder Ethyl steht,  
20

R<sup>8</sup> für Methyl oder Ethyl steht und

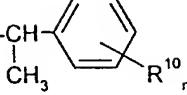
R<sup>9</sup> für Wasserstoff oder einen Rest der Formel



25

oder

- 9 -

R für einen Rest der Formel  steht, worin

R<sup>10</sup> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht  
und

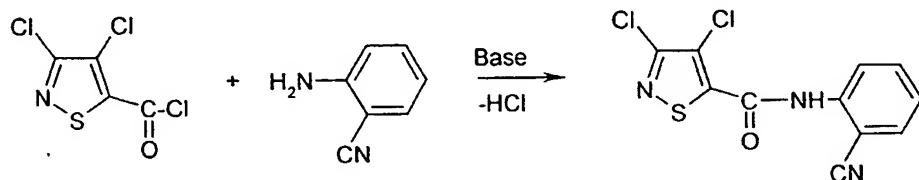
5

n für ganze Zahlen von 0 bis 3 steht, wobei R<sup>10</sup> für gleiche oder ver-  
schiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht.

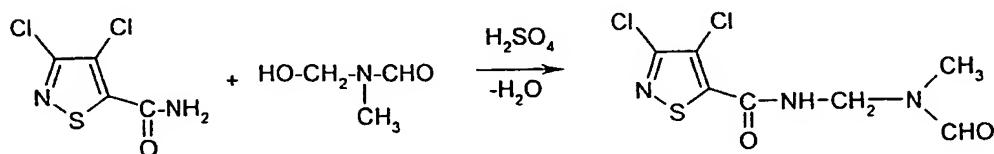
10 Die zuvor angegebenen Substituenten-Definitionen können untereinander kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Definitionen entfallen.

Verwendet man 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid und 2-Cyanoanilin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

15



20 Verwendet man 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid und N-Formyl-N-hydroxymethyl-methylamin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 10 -

Das bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoff benötigte 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-chlorid der Formel (II) ist bekannt (vgl. US-A-5 240 951).

5 Die weiterhin bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Reaktionskomponenten benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel hat R vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) als bevorzugt für diesen Rest genannt wurden.

10

Die Amine der Formel (III) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, ferner Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat oder Ammoniumcarbonat, oder tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder 25 Diazabicycloundecen (DBU).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrol-ether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylool oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlor-

methan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen -10°C und +150°C, vorzugsweise zwischen 10 0°C und 100°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem oder, sofern keine flüchtigen Komponenten an der Umsetzung beteiligt sind, unter vermin- 15 dertem Druck zu arbeiten.

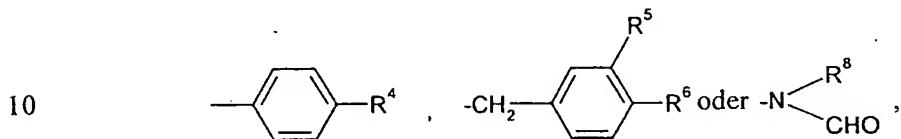
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 Mol an 20 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-chlorid der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 5 Mol, vorzugsweise 1 bis 2 Mol an Amin der Formel (III) sowie eine äquivalente Menge oder einen Überschuß an Säurebindemittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das Reak- 25 tionsgemisch nach beendeter Umsetzung einengt, den verbleibenden Rückstand mit Wasser und einem mit Wasser wenig mischbaren organischen Lösungsmittel versetzt, die organische Phase abtrennt, wäscht, trocknet und einengt. Das ver- bleibende Produkt kann nach üblichen Methoden von eventuell enthaltenen Verunreinigungen befreit werden.

- 12 -

Das bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoff benötigte 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid der Formel (IV) ist bekannt (vgl. US-A-5 240 951).

- 5 Die weiterhin bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Reaktionskomponenten benötigten Hydroxyverbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel steht

X vorzugsweise für einen Rest der Formel



worin

- 15 R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder N,N-Dialkyl-aminomethyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil steht,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff oder Alkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen steht,

- 20 R<sup>6</sup> für Alkoxy mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenoxy steht,

25 oder

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Phenoxy steht und

R<sup>6</sup> für Wasserstoff steht und

R<sup>8</sup> für Methyl oder Ethyl steht.

5

Die Hydroxyverbindungen der Formel (V) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien 10 in Frage. Vorzugsweise verwendbar ist Eisessig.

Als wasserabspaltende Mittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle üblichen Reagenzien in Betracht, die zur Dehydratation befähigt 15 sind. Vorzugsweise verwendbar sind Säuren, wie Schwefelsäure oder p-Toluolsulfinsäure, und auch Trockenmittel, wie wasserfreies Kieselgel.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) innerhalb eines größeren Bereichs variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 20 10°C und 130°C.

Auch bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem oder 25 vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man auf 1 Mol an 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid der Formel (IV) im allgemeinen 1 bis 2 Mol, vorzugsweise 1 bis 1,5 Mol an Hydroxyverbindung der Formel (V) sowie 2 bis 30 6 Mol an wasserabspaltendem Mittel ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, daß man das

Reaktionsgemisch mit Wasser versetzt, dann mit einem mit Wasser wenig mischbaren organischen Solvens extrahiert, die vereinigten organischen Phasen trocknet und unter verminderter Druck einengt. Das verbleibende Produkt kann nach üblichen Methoden von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit  
5 werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke pflanzenstärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

10 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, daß die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende  
15 Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 20 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen neben der pflanzenstärkenden (resistenz-induzierenden) Wirkung auch eine starke mikrobizide Wirkung auf und werden auch zur direkten Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen praktisch eingesetzt. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Pflanzenschutzmittel, insbesondere als Fungizide geeignet.

Zu den unerwünschten Mikroorganismen im Pflanzenschutz gehören Pilze aus den Klassen Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

- 5      Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen Krankheiten, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;

- 10     *Phytophthora*-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;

*Pseudoperonospora*-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;

- 15     *Plasmopara*-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

*Peronospora*-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *Peronospora brassicae*;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;

- 20     *Sphaerotheca*-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;

*Podosphaera*-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;

- 25     *Venturia*-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;

*Pyrenophora*-Arten, wie beispielweise *Pyrenophora teres* oder *Pyrenophora graminea* (Konidienform: *Drechslera*, Synonym: *Helminthosporium*);

- 30     *Cochliobolus*-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus* (Konidienform: *Drechslera*, Synonym: *Helminthosporium*);

- Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- 5 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
- 10 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
- Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
- 15 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
- 20 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
- Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
- 25 Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercosporella herpotrichoides*.
- Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen, erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, sowie auch eine Behandlung von Pflanz- und Saatgut und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Erysiphe-Arten, oder von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen 5 Plasmopara- oder Venturia-Arten, oder von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia-Arten einsetzen. Mit gutem Erfolg lassen sich mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen auch weitere Pflanzenkrankheiten, wie beispielsweise Septoria-, Cochliobolus-, Pyrenophora- und Pseudocercosporella-Arten bekämpfen, wobei Drechslera teres speziell genannt sei.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

15

Die erfindungsgemäß verwendbaren Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Gartenbau, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor bzw. im veterinärmedizinischen Bereich vorkommen. Die Stoffe 20 sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen Schädlinge in allen oder einzelnen Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten tierischen Schädlingen gehören:

25

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spec.

30

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

5

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea madera*e, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria* *migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

10

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

15

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus* spp.

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp.

20

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

25

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephrotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*,  
Cheimatobia brumata, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella*  
maculipennis, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.,  
*Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,  
5 *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis*  
flammea, *Spodoptera litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa*  
*pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria*  
*mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*,  
*Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clytia ambiguella*,  
10 *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*,  
*Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*,  
*Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chryso-*  
15 *cephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Antho-*  
*nomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*,  
*Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp.,  
*Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus*  
20 *hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,  
*Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra*  
*zealandica*.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp.,  
25 *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.,  
*Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*,  
*Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp.,  
30 *Stomoxyx* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hor-*  
*tulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus*  
*oleae*, *Tipula paludosa*.

- 20 -

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp.

Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

5

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermaphyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp.

10

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp.,  
15 Trichodorus spp.

15

Die erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Milben, wie gegen die Bohnenspinnmilbe (Tetranychus urticae), oder zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Insekten, wie gegen die Raupen der Kohlschabe (Plutella maculipennis), die Larven des Meerrettichblattkäfers (Phaedon cochleariae), sowie der grünen Reiszikade (Nephrotettix cincticeps), einsetzen.

20

Die erfindungsgemäßen Stoffe besitzen auch eine herbizide Wirksamkeit.

25

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

30

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkynaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethyleketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

**Fungizide:**

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,  
Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos,  
Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat,  
Buthiobat,

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon,  
Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chlo-  
ropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyprocona-  
zol, Cyprodinil, Cyprofuram,

5 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Dietho-  
fencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M,  
Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine,  
Drazoxolon,

10 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,  
Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan,  
Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fenthydroxyd, Ferbam,  
Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol,  
Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-  
Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol,  
15 Furconazol-cis, Furmecyclox,  
Guazatin,  
Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,  
Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat,  
Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Iso-  
20 valedione,  
Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kup-  
fernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bor-  
deaux-Mischung,  
Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl,  
25 Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax,  
Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,  
Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,  
Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfentiin,  
30 Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin,  
Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon,

- 24 -

- Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenoxy,  
Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,  
Quinconazol, Quintozon (PCNB),  
Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,  
5 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol,  
10 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram sowie Dagger G, OK-8705, OK-8801,  
15  $\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor- $\beta$ -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy- $\alpha$ -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
20 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon, (E)- $\alpha$ -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid, {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester, 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,  
25 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion, 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion, 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol, 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol, 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
30 1-[1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol, 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,

- 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carbox-anilid,
- 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
- 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
- 5 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
- 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
- 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
- 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- $\beta$ -D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-
- 10 methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
- 2-Aminobutan,
- 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
- 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
- 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
- 15 2-Phenylphenol(OPP),
- 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
- 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
- 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
- 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
- 20 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
- 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
- 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
- 8-Hydroxychinolinsulfat,
- 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
- 25 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
- cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
- cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,
- Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
- 30 Kaliumhydrogencarbonat,
- Methantetrathiol-Natriumsalz,

- Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.  
5 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
10 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl-cyclopropancarboxamid,  
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinloyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
15 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioat,  
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,  
spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on.

20 **Bakterizide:**

Bromopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethylthiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

25

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

30 Abamectin, Acephat, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin, Bacillus thuringiensis, 4-Bromo-2-(4-chlorphenyl)-1-(ethoxymethyl)-5-(trifluoromethyl)-1H-pyrrole-3-carbonitrile, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Betacyfluthrin,

Bifenthrin, BPMC, Brofenprox, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butocarb-oxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloetho-carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos,

5 N-[(6-Chloro-3-pyridinyl)-methyl]-N'-cyano-N-methyl-ethanimidamide, Chlor-pyrifos, Chlorpyrifos M, Cis-Resmethrin, Clopythrin, Clofentezin, Cyanophos, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazin, Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthuron, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicliphos, Dicrotophos, Diethion, Diflubenzuron, Dime-thoat,

10 Dimethylvinphos, Dioxathion, Disulfoton,

Edifenphos, Emamectin, Esfenvalerat, Ethiofencarb, Ethion, Ethofenprox, Ethoprophos, Etriphos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatinoxid, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb,

15 Fenoxy carb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyroximat, Fenthion, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flufen-prox, Fluvalinate, Fonophos, Formothion, Fosthiazat, Fubfenprox, Furathiocarb, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox,

Imidacloprid, Iprobenfos, Isazophos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,

20 Lamda-cyhalothrin, Lufenuron,

Malathion, Mecarbam, Mevinphos, Mesulfenphos, Metaldehyd, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Milbemectin, Monocrotophos, Moxidectin,

Naled, NC 184, Nitenpyram,

25 Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M, Oxydeprofos,

Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthroate, Phorat, Phosalon, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos M, Pirimiphos A, Profenophos, Promecarb, Propaphos, Propoxur, Prothiophos, Prothoat, Pymetrozin, Pyrachlophos, Pyri-daphenthion, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyrimidifen, Pyriproxifen,

30 Quinalphos,

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Sulfotep, Sulprofos.

Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin,  
Temephos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiafenoxy, Thiodicarb, Thiosfanox,  
Thiomethon, Thionazin, Thuringiensin, Tralomethrin, Triarathen, Triazophos,  
Triazuron, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,  
5 Vamidothion, XMC, Xylilcarb, Zetamethrin.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit  
Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

10 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-  
reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-  
pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die  
Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprü-  
hen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich,  
15 die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die  
Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann  
auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

20 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe zur Bekämpfung von Mikro-  
organismen können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines  
größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen  
die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha,  
vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die  
Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilo-  
25 gramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei  
der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen  
zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

30 Auch beim Einsatz gegen tierische Schädlinge können die erfindungsgemäßen Stoffe  
in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen  
bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten

sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

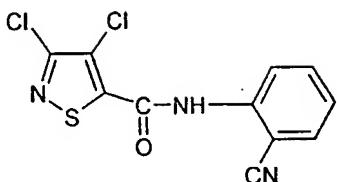
Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

- 30 -

### Herstellungsbeispiele

#### Beispiel 1

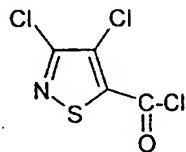


5

In ein Gemisch aus 20,8 g (0,1725 Mol) 2-Cyano-anilin und 250 ml Pyridin werden bei 5 bis 10°C unter Rühren 38,1 g (0,15 Mol) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid innerhalb von 10 Minuten eingetropft. Nach beendeter Zugabe versetzt man das Reaktionsgemisch mit 70 ml absolutem Tetrahydrofuran und 30 ml Pyridin, lässt auf Raumtemperatur erwärmen und röhrt dann 75 Minuten bei Raumtemperatur. Anschließend wird das Reaktionsgemisch unter verminderter Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit 800 ml Wasser und 800 ml Essigsäureethylester verrührt. Der in dem Zweiphasen-Gemisch enthaltene Niederschlag wird abfiltriert, mit Essigsäureethylester gewaschen und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 31,7 g eines kristallinen Produktes vom Schmelzpunkt 191 bis 193°C.

Aus dem zweiphasigen Filtrat wird die wäßrige Phase abgetrennt und zweimal mit je 150 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann unter verminderter Druck eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird mit 100 ml Petrolether und 25 ml Essigsäureethylester verrührt. Der anfallende Feststoff wird abgesaugt, mit Essigsäureethylester nachgewaschen und getrocknet.

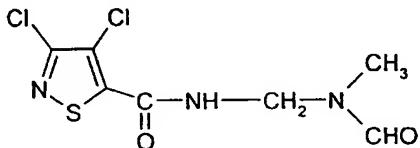
Man erhält auf diese Weise insgesamt 40 g (89 % der Theorie) an 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-(2-cyano-anilid) in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 191 bis 193°C.

**Herstellung des Ausgangsproduktes:**

5      In 8,92 g (0,045 Mol) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure werden bei Raumtemperatur innerhalb von 5 Minuten unter Rühren 146 g (1,23 Mol) Thionylchlorid eingetropft. Danach fügt man 4 Tropfen Dimethylformamid hinzu und erhitzt das Reaktionsgemisch eine Stunde unter Rückfluß. Anschließend wird das Reaktionsgemisch auf Raumtemperatur abgekühlt und unter verminderterem Druck eingeengt. Man erhält  
 10     auf diese Weise 12,19 g an 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid in Form eines orangefarbenen Öles.

**Beispiel 2**

15



In ein Gemisch aus 32,3 g (0,164 Mol) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid und 245 ml Eisessig werden unter Rühren bei Raumtemperatur 15 g (0,164 Mol) N-Formyl-N-hydroxymethyl-methylamin gegeben. Danach tropft man unter Rühren bei Raumtemperatur 37 g (0,362 Mol) konzentrierte Schwefelsäure hinzu, wobei das Reaktionsgemisch mit Eis gekühlt wird. Anschließend wird das Reaktionsgemisch 29 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und dann unter Eiskühlung mit 400 ml Wasser versetzt. Man extrahiert das entstehende Gemisch viermal mit je 200 ml Methylenchlorid, trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt dann unter verminderterem Druck ein. Der verbleibende ölige Rückstand wird mit Essigsäureethylester an Kieselgel chromatographiert. Nach dem Einengen des  
 20     25

Eluates erhält man 20,7 g (42,6 % der Theorie) an 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäure-(N-formyl-N-methyl-amino)-methylamid in Form einer kristallinen Festsubstanz vom Schmelzpunkt 87 bis 88°C.

5      **Herstellung der Ausgangsstoff:**



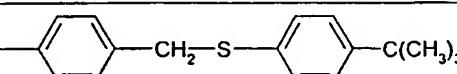
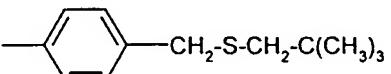
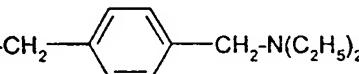
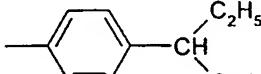
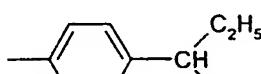
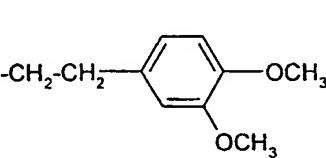
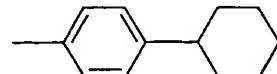
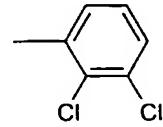
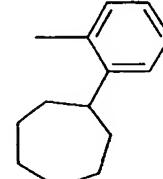
In 82 g (1,2 Mol) konzentrierten Ammoniak werden bei 0 bis 10°C innerhalb von  
10 Minuten unter Röhren 50,1 g (0,2 Mol) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid eingetropft. Nach beendeter Zugabe fügt man erneut 41 g (0,6 Mol) konzentrierten Ammoniak hinzu und verdünnt mit 70 ml Wasser. Man lässt auf Raumtemperatur erwärmen und röhrt 45 Minuten bei dieser Temperatur. Der entstandene Niederschlag wird abgesaugt, nacheinander mit Wasser und Petrolether gewaschen und  
15 getrocknet. Man erhält auf diese Weise 32,3 g (81,8 % der Theorie) an 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid in Form einer Festsubstanz vom Schmelzpunkt 156 bis 158°C.

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der folgenden Tabelle  
20 aufgeführten Stoffe der Formel (I) hergestellt.

**Tabelle 1**

Beispiel-Nr.	R	Physikalische Konstanten
3		Fp = 148-149°C log P = 4,81*); $\lambda$ = 218, 244 u. 266 nm**)
4		log P = 4,86; $\lambda$ = 234 u. 270 nm
5		log p = 4,79; $\lambda$ = 232 u. 270 nm
6		log P = 3,15; $\lambda$ = 242 u. 266 nm
7		Fp = 91-92°C
8		Fp = 171-172°C
9		Fp = 70-75°C
10		Fp = 115-117°C
11		

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Beispiel-Nr.	R	Physikalische Konstanten
12		Fp = 126-128°C
13		Fp = 91-92°C
14		log P = 1,39; λ = 219 u. 243 nm
15		Fp = 98-99°C
16		Fp = 83-85°C
17		Fp = 81-83°C
18		Fp = 162-163°C
19		Fp = 196°C
20		Fp = 122-125°C

**Tabelle 1** (Fortsetzung)

Beispiel-Nr.	R	Physikalische Konstanten
21		Fp = 83-84°C (Zers.)
22		Fp = 129-130°C
23		Fp = 135-136°C
24		Fp = 88-89°C
25		Fp = 89-90°C

\*) Die Bestimmung der log P-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure).

5

\*\*) Die  $\lambda$ -Werte bezeichnen Maxima im UV-Spektrum.

VerwendungsbeispieleBeispiel A5      **Pyricularia-Test (Reis) / Resistenzinduktion**

Lösungsmittel :        2,5    Gewichtsteile Aceton

Emulgator:            0,06    Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10     Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

15     Zur Prüfung auf resistenzinduzierende Wirksamkeit bespritzt man junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 5 Tage nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von Pyricularia oryzae inkuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 25°C aufgestellt.

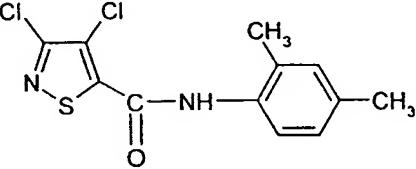
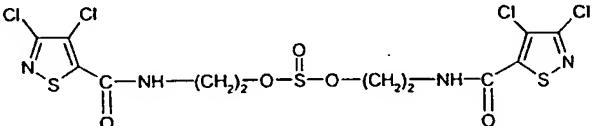
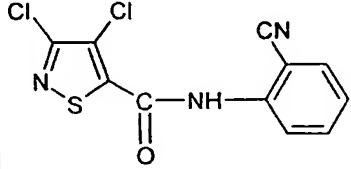
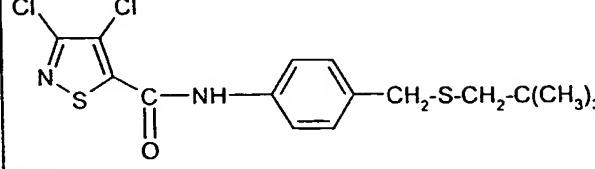
20     4 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

25     Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

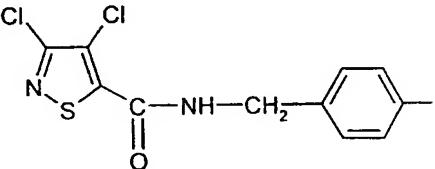
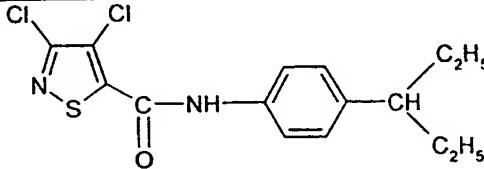
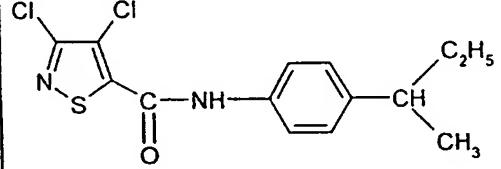
- 37 -

**Tabelle A****Pyricularia-Test (Reis) / Resistenzinduktion**

5

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß:</u>   (9)	750	90
 (10)	750	90
 (1)	750	90
 (13)	750	90

**Tabelle A (Fortsetzung)****Pyricularia-Test (Reis) / Resistenzinduktion**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
 (14)	750	100
 (15)	750	90
 (16)	750	90

**Beispiel B****Phaedon-Larven-Test**

5      Lösungsmittel :      7      Gewichtsteile Dimethylformamid  
Emulgator:                1      Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

15     Nach 7 Tagen wird der Abtötungsgrad bestimmt und in Prozent ausgedrückt. Dabei bedeutet ein Wirkungsgrad von 100 %, daß alle Käferlarven abgetötet wurden, während ein Wirkungsgrad von 0 % bedeutet, daß keine Käferlarven abgetötet wurden.

20     Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 40 -

**Tabelle B****Phaedon-Larven-Test / pflanzenschädigende Insekten**

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in Gew.-%	Abtötungsgrad in % nach 7d
 (3)	0,1	100

**Beispiel C****Plutella-Test**

- 5      Lösungsmittel:      7 Gewichtsteile Dimethylformamid  
                Emulgator:      1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10     Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (*Plutella xylostella*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

- 15     Nach 7 Tagen wird der Abtötungsgrad bestimmt und in Prozent ausgedrückt. Dabei bedeutet ein Wirkungsgrad von 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden, während ein Wirkungsgrad von 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.
- 20     Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 42 -

Tabelle C

## Plutella-Test / pflanzenschädigende Insekten

Wirkstoff	Wirkstoff- konzentration in Gew.-%	Abtötungsgrad in % nach 7d
	0,1	100
	0,1	100
	0,1	100
	0,1	100
	0,1	100

**Beispiel D****Venturia-Test (Apfel) / protektiv**

5      Lösungsmittel: 47 Gewichtsteile Aceton  
Emulgator:        3    Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Ge-  
wichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und  
10     verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoff-  
zubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des  
Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Konidiensuspension des  
15     Apfelschorferregers Venturia inaequalis inkokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca.  
20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luft-  
feuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

20     12 Tage nach der Inkokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wir-  
kungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von  
100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

25     Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden  
Tabelle hervor.

**Tabelle D****Venturia-Test (Apfel) / protektiv**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß:</u>   (6)	100	96

- 45 -

**Beispiel E**

**Leptosphaeria nodorum-Test (Weizen) / protektiv**

5      Lösungsmittel: 10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon  
Emulgator:        0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

10     Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

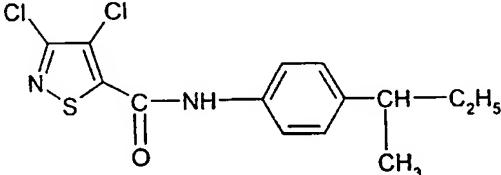
15     Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von Leptosphaeria nodorum besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20     Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 15°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt.

25     10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, daß kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

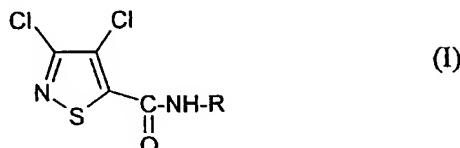
**Tabelle E****Leptosphaeria nodorum-Test (Weizen) / protektiv**

Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
<u>Erfindungsgemäß:</u>   (16)	250	81

- 47 -

Patentansprüche

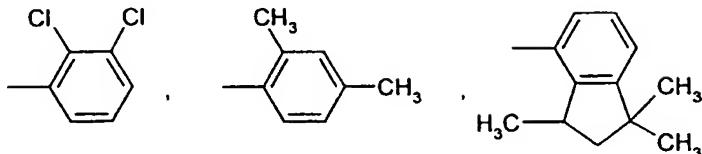
1. Isothiazolcarbonsäureamide der Formel



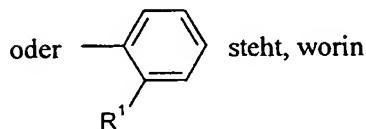
5

in welcher

R für einen Rest der Formel



10



steht, worin

R<sup>1</sup> für Cyano, Phenyl oder Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoff-  
atomen steht,

15

oder

R für einen Rest der Formel ——R<sup>2</sup> steht, worin

20

R<sup>2</sup> für -C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, —CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)—C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> , —CH(CH<sub>3</sub>)—C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> ,

- 48 -

Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen oder für  $-\text{CH}_2\text{-S-}\text{R}^3$   
steht, wobei

5             $\text{R}^3$         für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder für gege-  
benenfalls durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 6  
Kohlenstoffatomen substituiertes Phenyl steht,

oder

10            R        für einen Rest der Formel  $-\text{CH}_2\text{-}\begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ | \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array}\text{-}\text{R}^4$  steht, worin

$\text{R}^4$         für Wasserstoff oder N,N-Dialkylaminomethyl mit 1 bis 4  
Kohlenstoffatomen in jedem Alkylteil steht,

15            oder

        R        für einen Rest der Formel  $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-}\begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ | \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array}\text{-}\text{R}^6$  steht, worin

20             $\text{R}^5$         für Wasserstoff oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen  
steht und

25             $\text{R}^6$         für Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkyl mit 1 bis 6  
Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch Halogen substitui-  
tes Phenyl oder für gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes Phenoxy steht,

oder

- 49 -

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Phenoxy steht und

5 R<sup>6</sup> für Wasserstoff steht,

oder

R für einen Rest der Formel  $\begin{array}{c} \text{COOR}^7 \\ | \\ -\text{CH}- \\ | \\ \text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$ ,  $-\text{CH}_2-\text{N}\begin{array}{l} \diagup \text{R}^8 \\ \diagdown \text{CHO} \end{array}$  oder

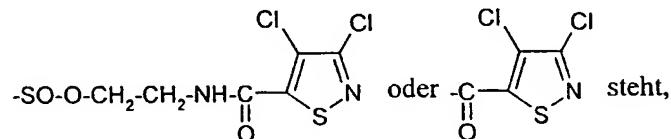
10  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{R}^9$  steht, worin

R<sup>7</sup> für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

R<sup>8</sup> für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

15

R<sup>9</sup> für Wasserstoff oder einen Rest der Formel



oder

20

R für einen Rest der Formel  $-\text{CH}-$

steht, worin

R<sup>10</sup> für Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht und

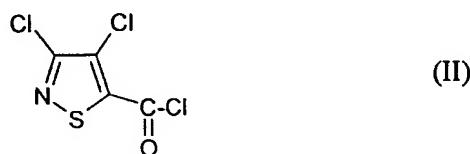
25

n für ganze Zahlen von 0 bis 3 steht.

- 50 -

2. Verfahren zur Herstellung von Isothiazolcarbonsäureamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

5 a) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäurechlorid der Formel



mit Aminen der Formel

10 H<sub>2</sub>N-R (III)

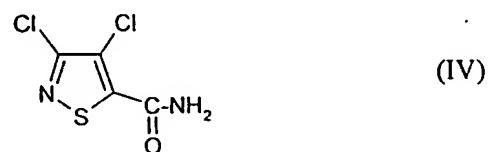
in welcher

15 R die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

20 oder

b) 3,4-Dichlor-isothiazol-5-carbonsäureamid der Formel



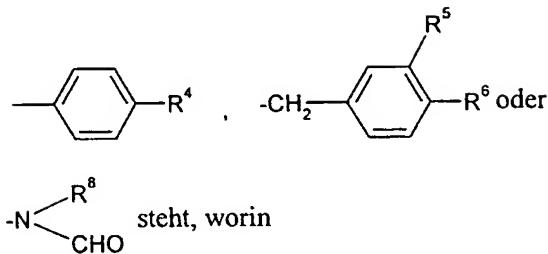
25

mit Hydroxyverbindungen der Formel



5                   in welcher

X                für einen Rest der Formel



10

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> und R<sup>8</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines was-  
serabspaltenden Mittels umsetzt.

15

- 3. Mittel zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Isothiazolcarbonsäureamid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

20

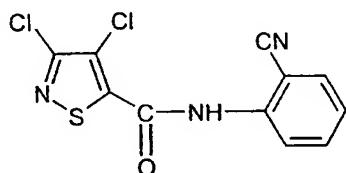
- 4. Verwendung von Isothiazolcarbonsäureamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge.

25       5.

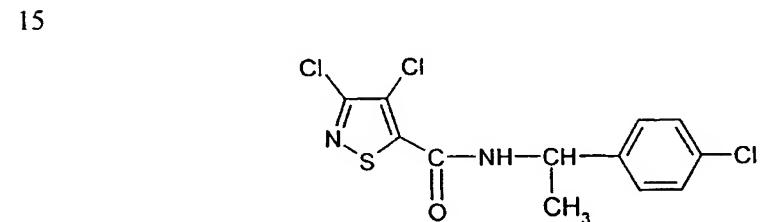
- Verfahren zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, daß man Iso-

thiazolcarbonsäureamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Pflanzen und/oder deren Lebensraum aus bringt.

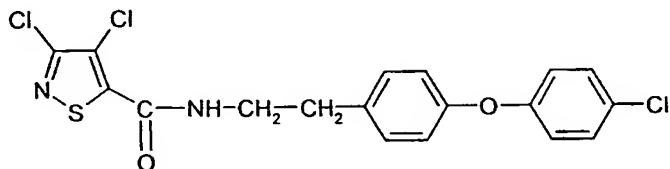
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge, dadurch gekennzeichnet, daß man Isothiazolcarbonsäureamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 5
7. Isothiazolcarbonsäureamid gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die Formel



- 10
8. Isothiazolcarbonsäureamid gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die Formel

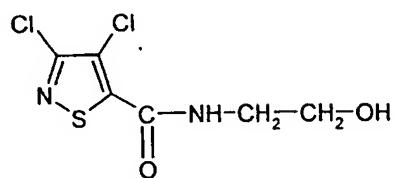


9. Isothiazolcarbonsäureamid gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die Formel



- 53 -

10. Isothiazolcarbonsäureamid gemäß Anspruch 1, gekennzeichnet durch die Formel



5

**PCT**WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICH NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :  C07D 275/02, A01N 43/80		A3	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 99/24413</b>  (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Mai 1999 (20.05.99)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/07056  (22) Internationales Anmeldedatum: 5. November 1998 (05.11.98)		dayashi, Yuki-shi, Ibaraki 307-0007 (JP). SAKUMA, Haruhiko [JP/JP]; 4-29-19, Higashijonan, Oyama-shi, Tochigi 323-0829 (JP).	
(30) Prioritätsdaten: 197 50 012.9 12. November 1997 (12.11.97) DE		(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).	
(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).		(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): ASSMANN, Lutz [DE/DE]; Schimmelreiterweg 6, D-25826 St. Peter-Ording (DE). KUHNT, Dietmar [DE/DE]; Eschenallee 6d, D-51399 Burscheid (DE). ELBEE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, D-42329 Wuppertal (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüschhof 15, D-42799 Leichlingen (DE). DUTZMANN, Stefan [DE/DE]; Weissenstein 95, D-40764 Langenfeld (DE). HÄNSSLER, Gerd [DE/DE]; Am Arenzberg 58a, D-51381 Leverkusen (DE). STENZEL, Klaus [DE/DE]; Seesener Strasse 17, D-40595 Düsseldorf (DE). MAULER-MACHNIK, Astrid [DE/DE]; Neuenkamper Weg 46a, D-42799 Leichlingen (DE). KITAGAWA, Yoshinori [JP/JP]; 1085, Ara-machi, Moka-shi, Tochigi 321-4305 (JP). SAWADA, Haruko [JP/JP]; 848-4, Oba-		<b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i> <i>Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist. Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen.</i>	
		(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts: 1. Juli 1999 (01.07.99)	
<p><b>(54) Title:</b> ISOTHIAZOLE CARBOXYLIC ACID AMIDES AND THE APPLICATION THEREOF IN ORDER TO PROTECT PLANTS</p> <p><b>(54) Bezeichnung:</b> ISOTHIAZOLCARBONSÄUREAMIDE UND DEREN VERWENDUNG ZUM SCHUTZ VON PFLANZEN</p> <p style="text-align: center;"> <span style="margin-left: 20px;">(I)</span> </p> <p><b>(57) Abstract</b></p> <p>The invention relates to novel isothiazole carboxylic acid amides of formula (I) in which R has the meanings given in the description. The invention also relates to additional methods for producing the novel materials and the application thereof in order to protect plants against attack by undesired microorganisms and animal pests.</p> <p><b>(57) Zusammenfassung</b></p> <p>Neue Isothiazolcarbonsäureamide der Formel (I) in welcher R die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen hat, mehrere Verfahren zur Herstellung der neuen Stoffe und deren Verwendung zum Schutz von Pflanzen gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen und tierische Schädlinge.</p>			

#### ***LEDIGLICH ZUR INFORMATION***

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estonien						

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internat.	Application No
PCT/EP 98/07056	

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 IPC 6 C07D275/02 A01N43/80

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols),  
 IPC 6 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 209 (C-1190), 13 April 1994 (13.04.94) & JP 06 009313 A (MITSUI TOATSU CHEM INC), 18 January 1994 cited in the application see abstract; examples 25,26,36-38 ---	1,7-9
Y	US 5 240 951 A (SHIMOTORI HITOSHI ET AL) 31 August 1993 (31.08.93) cited in the application see claim 1; examples 3,19-23 ---	1,7-10
Y	EP 0 313 091 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS) 26 April 1989 (26.04.89) see claim 1 ---	1,7-9
Y	DE 17 70 976 A (BAYER AG) 13 January 1972 (13.01.72) see claim 1; examples 7-9 ---	1,7-10
	-/-	

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 April 1999 (16.04.99)

Date of mailing of the international search report

07 May 1999 (07.05.99)

Name and mailing address of the ISA  
 European Patent Office, P.B. 5818 Patenttaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interna. J Application No  
PCT/EP 98/07056

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 3 341 547 A (PENNSALT CHEMICALS CORP.) 12 September 1967 (12.09.67) see claim 1 ---	1,7-9
A	US 4 906 280 A (SANDLER STANLEY R ET AL) 6 March 1990 (06.03.90) see claim 1 -----	1,7-9

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.

PCT/EP 98/07056

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.: because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
  
3.  Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
  
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
  
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International application No.  
PCT/EP98/07056

The International Searching Authority has found that this international application contains multiple inventions, as follows:

1. Claims Nos 1-6 (all parts), 7-9  
Compounds where R contains (substituted) phenyl

2. Claims Nos: 1-6 (all parts), 10  
Compounds where R does not contain phenyl

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Internati	Application No
	PCT/EP 98/07056

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
US 5240951	A 31-08-1993	JP 2530071 B JP 5059024 A KR 9501960 B CN 1061967 A,B		04-09-1996 09-03-1993 08-03-1995 17-06-1992
EP 0313091	A 26-04-1989	JP 2045402 A JP 2648621 B JP 2067207 A JP 2723155 B AU 626806 B DE 3883695 D DE 3883695 T ES 2058209 T JP 2149572 A JP 2788458 B RO 107655 A US 4980363 A US 5104886 A RO 106645 A RO 107181 A RO 107182 A RO 107337 A RO 107338 A CN 1035826 A,B CN 1066363 A DD 283323 A DD 296401 A DD 296484 A DD 296490 A JP 1230563 A PL 162128 B RO 107654 A		15-02-1990 03-09-1997 07-03-1990 09-03-1998 13-08-1992 07-10-1993 17-02-1994 01-11-1994 08-06-1990 20-08-1998 30-12-1993 25-12-1990 14-04-1992 30-06-1993 29-10-1993 29-10-1993 30-11-1993 30-11-1993 27-09-1989 25-11-1992 10-10-1990 05-12-1991 05-12-1991 05-12-1991 14-09-1989 30-09-1993 30-12-1993
DE 1770976	A 13-01-1972	NONE		
US 3341547	A 12-09-1967	BE 687381 A DE 1620142 A FR 1499492 A GB 1139690 A NL 128800 C NL 6613128 A US 3393992 A		28-03-1967 12-03-1970 25-01-1968  03-04-1967 23-07-1968
US 4906280	A 06-03-1990	NONE		

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internat... des Aktenzeichen  
PCT/EP 98/07056

**A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**  
IPK 6 C07D275/02 A01N43/80

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)  
IPK 6 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie <sup>a</sup>	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 018, no. 209 (C-1190), 13. April 1994 & JP 06 009313 A (MITSUI TOATSU CHEM INC), 18. Januar 1994 in der Anmeldung erwähnt siehe Zusammenfassung; Beispiele 25,26,36-38 ---	1,7-9
Y	US 5 240 951 A (SHIMOTORI HITOSHI ET AL) 31. August 1993 in der Anmeldung erwähnt siehe Anspruch 1; Beispiele 3,19-23 ---	1,7-10
Y	EP 0 313 091 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS) 26. April 1989 siehe Anspruch 1 ---	1,7-9
		-/-

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \*'A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*'E" altes Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*'L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*'O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*'P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
- \*'T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \*'X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \*'Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \*'8" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

16. April 1999

07 Mai 1999 (07-05-99)

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patenttaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Gettins, M

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Internat.	Ies Aktenzeichen
PCT/EP 98/07056	

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	DE 17 70 976 A (BAYER AG) 13. Januar 1972 siehe Anspruch 1; Beispiele 7-9 ---	1,7-10
Y	US 3 341 547 A (PENNSALT CHEMICALS CORP.) 12. September 1967 siehe Anspruch 1 ---	1,7-9
A	US 4 906 280 A (SANDLER STANLEY R ET AL) 6. März 1990 siehe Anspruch 1 -----	1,7-9

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 98/07056

### Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
  
2.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
  
3.  Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

### Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
  
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchengebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
  
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
  
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchengebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.  
 Die Zahlung zusätzlicher Recherchengebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-6 (alle Teile), 7-9

Verbindungen wo R ein (substituierte) Phenyl enthält.

2. Ansprüche: 1-6 (alle Teile), 10

Verbindungen wo R kein Phenyl enthält

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP 98/07056

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung		Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
US 5240951	A	31-08-1993		JP 2530071 B		04-09-1996
				JP 5059024 A		09-03-1993
				KR 9501960 B		08-03-1995
				CN 1061967 A,B		17-06-1992
<hr/>						
EP 0313091	A	26-04-1989		JP 2045402 A		15-02-1990
				JP 2648621 B		03-09-1997
				JP 2067207 A		07-03-1990
				JP 2723155 B		09-03-1998
				AU 626806 B		13-08-1992
				DE 3883695 D		07-10-1993
				DE 3883695 T		17-02-1994
				ES 2058209 T		01-11-1994
				JP 2149572 A		08-06-1990
				JP 2788458 B		20-08-1998
				RO 107655 A		30-12-1993
				US 4980363 A		25-12-1990
				US 5104886 A		14-04-1992
				RO 106645 A		30-06-1993
				RO 107181 A		29-10-1993
				RO 107182 A		29-10-1993
				RO 107337 A		30-11-1993
				RO 107338 A		30-11-1993
				CN 1035826 A,B		27-09-1989
				CN 1066363 A		25-11-1992
				DD 283323 A		10-10-1990
				DD 296401 A		05-12-1991
				DD 296484 A		05-12-1991
				DD 296490 A		05-12-1991
				JP 1230563 A		14-09-1989
				PL 162128 B		30-09-1993
				RO 107654 A		30-12-1993
<hr/>						
DE 1770976	A	13-01-1972		KEINE		
<hr/>						
US 3341547	A	12-09-1967		BE 687381 A		28-03-1967
				DE 1620142 A		12-03-1970
				FR 1499492 A		25-01-1968
				GB 1139690 A		
				NL 128800 C		
				NL 6613128 A		03-04-1967
				US 3393992 A		23-07-1968
<hr/>						
US 4906280	A	06-03-1990		KEINE		
<hr/>						